

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
19 février 2004 (19.02.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/014928 A2

(51) Classification internationale des brevets⁷ :

C07H 15/04

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR2003/002330

(22) Date de dépôt international : 23 juillet 2003 (23.07.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :

02/09627 25 juillet 2002 (25.07.2002) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : INSTITUT NATIONAL DES SCIENCES APPLIQUEES DE ROUEN (INSA) [FR/FR]; Place Emile Blondel - B.P.8, F-76130 Mont Saint Aignan (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : QUIRION, Jean-Charles [FR/FR]; 194 rue de Monfort, 27130 Bourg-Achard (FR). PANNECOUCKE, Xavier [FR/FR]; 32 rue du Vallon, 76150 Maromme (FR). D'HOOGHE François [FR/FR]; 14 rue Jacques Boutrolles, appartement 139, 76130 Mont Saint Aignan (FR). MARCOTTE, Stéphane [FR/FR]; 218 route d'Argueil, 76750 Buchy (FR). CASTELOT - DELIENCOURT - GODEFROY, Géraldine [FR/FR]; 22 rue Eugène Renault, 94700

Maisons Alfort (FR). JUBAULT, Philippe [FR/FR]; 89, allée de la Mare Sangsue, F-76160 Preaux (FR). GOUGE, Vanessa [FR/FR]; 2, rue Amédée Méreaux, F-76000 Rouen (FR).

(74) Mandataire : DE SAINT PALAIS, Arnaud; Cabinet Moutard, 35, rue de la paroisse, F-78000 Versailles (FR).

(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

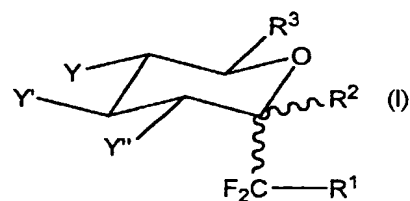
Déclaration en vertu de la règle 4.17 :

— relative à la qualité d'inventeur (règle 4.17.iv)) pour US seulement

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: NOVEL DIFLUORINATED GEM COMPOUNDS, PREPARATION METHODS THEREOF AND APPLICATIONS OF SAME

(54) Titre : NOUVEAUX COMPOSES GEM DIFLUORES, LEURS PROCEDES DE PREPARATION ET LEURS APPLICATIONS



(57) **Abstract:** The invention relates to a difluorinated gem compound having formula (I) wherein R¹ is a group comprising an alkyl chain that is substituted by at least one amine, amide or acid function, R² is a hydrogen atom H or a free or protected alcohol function, R³ is group H, CH₃, CH₂OH, CH₂-OGP wherein GP is a protecting group such as an alkyl, benzyl (Bn), trimethylsilyl (TMS), tert-butyldimethylsilyl (TBDMS), tert-butyldiphenylsilyl (TBDPS), acetate (Ac) group, etc. and Y, Y', Y'' are independent groups wherein Y, Y', Y'' = H, OR, N₃, NR'R'', SR', etc. with R = H, Bn, Ac, TMS, TBDMS, TBDPS, etc., R', R'' = H, alkyl, allyl, Bn, tosylate (Ts), C(=O)-alkyl, C(=O)-Bn, etc., R' = H, alkyl, Ac. The invention applies in particular to the use of said compound for the preparation of antitumoral, antiviral, hypoglycaemic and anti-inflammatory medicaments and compounds for immunology and cosmetology or glycopeptide analogues of antifreeze molecules.

C(=O)-Bn, etc., R' = H, alkyl, Ac. The invention applies in particular to the use of said compound for the preparation of antitumoral, antiviral, hypoglycaemic and anti-inflammatory medicaments and compounds for immunology and cosmetology or glycopeptide analogues of antifreeze molecules.

(57) **Abrégé :** Le produit selon l'invention concerne un composé gem difluoré de formule (I) où R₁ est un groupement comportant une chaîne alkyle substituée par au moins une fonction amine, amide ou acide, R₂ est un atome d'hydrogène H ou une fonction alcool libre ou protégée, R₃ est un groupement H, CH₃, CH₂OH, CH₂-OGP où GP est un groupe protecteur tel qu'un groupe alkyle, benzyle (Bn), triméthylsilyle (TMS), tert-butyldiméthylsilyle (TBDMS), tert-butyldiphénylsilyle (TBDPS), acétate (Ac),... Y, Y', Y'' sont des groupes indépendants où Y, Y', Y'' = H, OR, N₃, NR'R'', SR',... avec R = H, Bn, Ac, TMS, TBDMS, TBDPS, etc., R', R'' = H, alkyl, allyl, Bn, tosylate (Ts), C(=O)-alkyl, C(=O)-Bn, etc., R' = H, alkyl, Ac. Elle s'applique notamment à l'utilisation dudit composé pour la préparation de médicaments antitumoraux, antiviraux, hypoglycémisants, anti-inflammatoires et de composés pour l'immunologie, pour la cosmétologie, ou encore d'analogues glycopeptidiques de molécules antigél.